

Rec'd PCT/PTO

27 APR 2005

10/532755

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 25 FEB 2005

WIPO

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054071	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEAA16)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12767	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.11.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 15.11.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESellschaft et al		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 9 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 6 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
 - I ☒ Grundlage des Bescheids
 - II ☐ Priorität
 - III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
 - IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
 - V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
 - VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
 - VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
 - VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 28.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 28.02.2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Muellners, W Tel. +31 70 340-3289 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17):*

Beschreibung, Seiten

1-22 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-13 eingegangen am 30.11.2004 mit Schreiben vom 29.11.2004

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:

- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
- ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
- ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
- ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.

2. ☒ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.

3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3

- ☐ erfüllt ist.
- ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:

siehe Beiblatt

4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:

- ☒ alle Teile.
- ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. beziehen.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-13
Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 1-13

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Ja: Ansprüche: 1-13

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

zu Punkt IV

1.1 Im Lichte der Beschreibung (Seite 7, erster Absatz und Seite 9, letzter Absatz) und des Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die allgemeine der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung weiterer synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden zur Bekämpfung von Schadpilzen angesehen werden. Dabei wird zunächst die Bekämpfung von Mehltäupilzen besonders hervorgehoben.

1.2 Die tatsächlichen Beispiele richten sich aber auf andere und spezifischere Aufgaben nämlich die Bereitstellung weiterer hochwirksamer Mittel zur Bekämpfung von Reiskrankheiten und zur Bekämpfung von *Oomyceten* (siehe die Beschreibung Seite 10, die beiden ersten Absätze).

Die Beschreibung (siehe Seite 10, Absätze 3 und 4) hebt sogar ausdrücklich hervor, dass diese Aufgaben von der oben unter 1.1 hervorgehobenen Aufgabe deutlich verschieden sind und man deshalb nicht erwarten kann, dass die jeweiligen Lösungen übertragbar sind.

Entsprechendes lässt sich auch für das Verhältnis zwischen diesen beiden in den Beispielen gelösten Aufgaben sagen.

Pathogene die typische Reiskrankheiten auslösen wie *Pyricularia oryzae*, *Cochliobolus miyabeanus* und *Corticium sasakii* (syn. *Rhizoctonia solani*) sind *Ascomyceten* bzw. *Basidiomyceten* nicht *Oomyceten*. Andererseits sind typische *Oomyceten* wie *Phytophthora infestans* und *Plasmopara viticola* keine Reispathogene. Somit scheint bereits das a priori Einheitlichkeit herstellende gemeinsame besondere technische Merkmal des gesamten Anspruchsgegenstandes zu fehlen, nämlich dass er die gleiche Aufgabe löst. Es liegt also bereits a priori Uneinheitlichkeit vorliegt (Regel 13.1 und 13.2 PCT)

Es ist als reiner Zufall anzusehen, dass die beiden Aufgaben die gleiche Lösung haben. Da aber der Anspruchsgegenstand in seiner gegenwärtigen Definition durch diese zufällige Identität der Lösungen zwangsläufig beide Aufgaben löst, erübrigt sich eine Unterteilung aufgrund einer solchen Uneinheitlichkeit. Hierbei wird auch der Gegenstand der Ansprüche 8 und 9 als identisch betrachtet, da ein Verfahren lediglich durch die Verfahrensschritte gekennzeichnet ist. Die Absicht mit der ein Verfahren durchgeführt wird ist für das Verfahren als solches nicht von Belang. Im Unterschied dazu wären entsprechende Verwendungsansprüche (zur Bekämpfung von Reiskrankheiten bzw. zur Bekämpfung von *Oomyceten*) als voneinander verschiedene Erfindungsgegenstände zu

betrachten,

2. Darüber hinaus ist der Anspruchsgegenstand aber auch als a posteriori uneinheitlich zu betrachten.

Begründung:

Im folgenden wird der Anspruchsgegenstand als Lösung der ersten oben unter 1.2 angeführten spezifischen Aufgabe (Bekämpfung von Reiskrankheiten) betrachtet. Für eine Betrachtung als Lösung der zweiten spezifischen Aufgabe (Bekämpfung von *Oomyceten*) ergäben sich analoge Überlegungen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins der Formel I (im folgenden als TP1 bezeichnet) in Kombination mit einem fungiziden Azolderivat ausgewählt aus einer Liste von 17 solchen Derivaten gekennzeichnet.

D1 offenbart Kombinationen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel unter der auch TP1 fällt, mit unter anderem fungiziden Triazolderivaten. Bevorzugt haben die Triazolopyrimidine als Substituenten einen 2-Chlor-6-fluoro- oder einen 2,4,6-Trifluorophenyl- Substituenten. Bevorzugt und durch Beispiele belegte Verbindungen dieser Struktur sind das 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analoge des TP1 der vorliegenden Anmeldung, das ebenfalls einen 7-(4-methylpiperid-1-yl)-Substituenten trägt (im folgenden TPa genannt) und das 7-(1,1,1-trifluoropropyl-2-ylamino)-Analoge des TP1, das ebenfalls einen 2,4,6-Trifluorophenyl-Substituenten trägt, im folgenden TPb genannt.

Die bevorzugten Triazolderivate fallen unter eine Formel unter der auch die Azole gemäß Formel (III), (VIII) und (XVI) (Difenoconazole, Hexaconazole, Ipcoconazole) der vorliegenden Anmeldung fallen. Durch Beispiele belegt sind Mischungen mit Tebuconazole, das dem Azol der Formel VIII (Hexaconazole) nahesteht, Metconazole, das den Azolen der Formeln XVI und XVII (Ipconazole, Triticonazole) sehr nahesteht (es ist das Di-hydroderivat des Letzteren), Propiconazole, das dem Azol der Formel (III) (Difenoconazole) nahesteht, sowie Cyproconazole und Epoxiconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D1).

Das dem gesamten Anmeldungsgegenstand gemeinsame technische Merkmal ist die Kombination des spezifischen Fungizids TP1 mit Fungiziden, die als Merkmal gemeinsam haben, dass sie sogenannte Conazole sind.

Hinsichtlich des letzteren ist festzustellen, dass das Vorliegen eines solchen Merkmal im Stand der Technik implizit als ausreichend angesehen wird, um für Gegenstände die dieses Merkmal teilen und sich nur in weiteren Details unterscheiden gleiche technische Effekte zu erwarten. D1 (siehe oben) illustriert das hinsichtlich synergistischer Effekte bereits durch die Tatsache, dass es eine allgemeine Formel für die Triazole verwendet. D2 illustriert diese Auffassung hinsichtlich allgemein in Aussicht stehender Vorteile von Kombinationen. Es wird dort nämlich vorgeschlagen die Verbindung TP1 mit fungiziden Azolen zu mischen. Aufgeführt werden sämtliche in der vorliegenden Anmeldung genannten Azole ausgenommen die der Formel XV und XVIII, auch genannt, und somit offenbar als äquivalent betrachtet, sind darüber hinaus die Beispielsverbindungen aus Entgegenhaltung D1: Tebuconazole, Metconazole, Cyproconazole, Epoxiconazole, und Propiconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D2).

Entgegenhaltung D3 schließlich, die synergistische fungizide Mischungen gewisser Strobilurin-Derivate mit insgesamt 17 Azolen, nämlich die ersten 12 der vorliegenden Anmeldung zusammen mit den 5 beispielhaften der Entgegenhaltung D1, offenbart, bestärkt den Fachmann in der Annahme, dass hinsichtlich der Erzielung synergistischer Effekte auch letztere und erstere sich gegenseitig vertreten können (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D3).

Das daraus nicht geschlossen werden kann, dass von Strobilurinen völlig verschiedene Triazolopyrimidine konkret mit diesen Azolen ebenfalls synergistisch wirken würden, hindert den Fachmann nicht an der Schlussfolgerung, dass man grundsätzlich erwarten kann, dass sich Azole in Hinblick auf synergistischen Effekte gegenseitig vertreten können. Das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung (Artikel 34(3)(a) in Verbindung mit Regel 13.1 PCT) wäre demnach erfüllt.

Selbstverständlich müssen aber hinsichtlich der Klasse zu der die erste Komponente gehört, d.h. den Triazolopyrimidinen gleiche Maßstäbe angelegt werden, wie für die zweite Komponente, d.h. die Triazole.

TP1 teilt vergleichbare gemeinsame Merkmale mit den Triazolopyrimidinen TPa und TPb des Standes der Technik.

Wenn es für den Fachmann nicht naheliegend ist zur Lösung der Aufgabe in den in Entgegenhaltung D1 vorgeschlagenen Mischungen, die u.a. durch eine allgemeine Formel für Triazolopyrimidine, die auch TP1 umfasst, charakterisiert sind, das TPa oder TPb der konkreten Beispiele gegen das überlegene TP1 auszutauschen, weil er Übertragbarkeit nicht erwartet hätte, dann muss dies auch innerhalb des gegenwärtigen

Anspruchsgegenstandes hinsichtlich der verschiedenen Triazole gelten.
Erkennt man dem Anspruchsgegenstand zu, dass er insgesamt auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht, ist jede der Kombination eine eigene Erfindung, das heißt sie war aus keiner der jeweils anderen herleitbar.

Daraus ergeben sich insgesamt 17 entsprechend definierte Erfindungen:

1. Fungizide Mischungen enthaltend als aktive Komponente das Triazolopyrimidin der Formel (I) des Anspruches 1 und ein Azolderivat oder dessen Salze oder Addukte der Formel II (Bromuconazole), entsprechende Verfahren etc.

17. und ein Azolderivat oder dessen Salze oder Addukte der Formel XVIII (Prothioconazole) ...

Da der gesamte Anmeldungsgegenstand recherchiert wurde und die Formulierung eines Prüfungsberichtes für sämtliche Gegenstände auf der Basis der gleichen Grundüberlegungen in analoger Weise erfolgen kann, sieht die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde keinen Anlass zur Zahlung weiterer Prüfungsgebühren aufzufordern.

zu Punkt V

In diesem Bescheid werden folgende im Recherchenbericht zitierten Entgegenhaltungen D1-D3 genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

D1 EP988790 A
D2 WO98/46607 A
D3 WO97/06678 A

Neuheit

Der gesamte Anspruchsgegenstand wird als neu angesehen (Artikel 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(2) PCT).

Der Stand der Technik offenbart nicht die Kombinationen des Triazolopyrimidins der Formel I (im folgenden TP1 genannt) mit einem der 17 aufgeführten Azolfungizide.

Erfinderische Tätigkeit

Die gesamte Anspruchsgegenstand wird als auf einer erfinderischen Tätigkeit beruhend angesehen (Artikel 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(3) PCT).

Die folgende Begründung geht von der ersten oben unter IV genannten Erfindung (Mischungen mit Bromuconazole) und der ersten oben unter IV-1.2 genannten Aufgabe aus (Bekämpfung von Reiskrankheiten).

Ausgehend von der zweiten Aufgabe (Bekämpfung von *Oomyceten*) ergäben sich analoge Überlegungen, die sich auf dem erheblichen, in der Beschreibung aber kaum belegten, Unterschied zwischen der Klasse der *Oomyceten* und den "echten" Pilzen der Klasse der *Ascomyceten* und *Basidiomyceten* stützen.

Entsprechende analoge Begründungen lassen sich für die übrigen oben unter IV definierten Erfindungen 2-17 formulieren.

Im Lichte der Beschreibung (insbesondere Seite 10, Zeilen 5-32) und des entsprechenden nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D2 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung von Triazolopyrimidin-Fungizide enthaltenden Mitteln zur Bekämpfung von Reiskrankheiten angesehen werden. Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit dem fungiziden Azolderivat Bromuconazole gekennzeichnet.

Der nächste Stand der Technik der Entgegenhaltung D2 offenbart Trifluorophenyl-triazolopyrimidine, darunter die Verbindung TP1. Es wird hervorgehoben (siehe D2, Seite 7, Zeilen 9-22), dass sie erhöhte Systemizität und Toxizität gegen Reiskrankheiten und Mehltau zeigen, besonders hervorgehoben wird die Eignung zur Bekämpfung des Mehltaupilzes *Uncinula necator*. In einem Vergleichsbeispiel wird gezeigt, dass sie dem 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analogue des TP1 (im folgenden TPa genannt) in der Bekämpfung von *Uncinula necator* überlegen ist. Auch wird dort vorgeschlagen sie mit fungiziden Azolen zu mischen. Aufgeführt wird dort auch Bromuconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D2).

D1 offenbart Kombinationen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel unter der auch TP1 fällt, mit unter anderem fungiziden Triazolderivaten. Bevorzugt haben die Triazolopyrimidine als Substituenten einen 2-Chlor-6-fluoro- oder einen 2,4,6-Trifluorophenyl- Substituenten. Bevorzugt und durch Beispiele belegte Verbindungen dieser Struktur sind das 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analogue des TP1 der vorliegenden Anmeldung,

das ebenfalls einen 7-(4-methylpiperid-1-yl-Substituenten trägt (TPa) und das 7-(1,1,1-trifluoropropyl-2-ylamino)-Analoge des TP1, das ebenfalls einen 2,4,6-Trifluorophenyl-Substituenten trägt. Als zu bekämpfende Pilze werden Arten der Gattungen *Blumeria*, *Botrytis*, *Septoria*, *Erysiphe* und *Puccinia* genannt deren erfolgreiche Bekämpfung auf Weizen, Gerste, Äpfeln, Gurken und Tomaten in Beispielen gezeigt wird. Die bevorzugten Triazolderivate sind Cyproconazole, Epoxiconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole. Bromuconazole wird nicht ausdrücklich erwähnt (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgeghaltung D1).

Angeichts der spezifischen Anforderungen an die Bekämpfung von Reiskrankheiten (siehe die Beschreibung der vorliegenden Anmeldung Seite 10, Zeilen 8-32) konnte der Fachmann nicht erwarten, dass die Kombination der aus D2 bekannten Verbindung TP1 mit dem Conazol Bromuconazole zu einem hochwirksamen Mittel zur Bekämpfung von Reiskrankheiten führen würde. Eine solche Mischung entspräche dem Austausch der in D1 verwendeten Triazolopyrimidine durch TP1, dessen Überlegenheit D2 aber nur hinsichtlich der Bekämpfung des Mehltaupilzes *Ucinula necator* demonstriert, bei gleichzeitigem Austausch der in D1 verwendeten Conazol-Mischungspartner durch das dort nicht erwähnte Bromuconazole, wobei obendrein D1 keine besondere Eignung seiner Kombinationen für die Bekämpfung von Reiskrankheiten nahelegt.

Industrielle Anwendbarkeit

Der Anspruchsgegenstand wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) und (4) PCT).